

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2005 年 3 月 31 日 (31.03.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/027932 A1

- (51) 国際特許分類<sup>7</sup>: A61K 31/606, 47/02, 47/12, 47/20, 47/22, A61P 1/04
- (21) 国際出願番号: PCT/JP2004/013627
- (22) 国際出願日: 2004 年 9 月 17 日 (17.09.2004)
- (25) 国際出願の言語: 日本語
- (26) 国際公開の言語: 日本語
- (30) 優先権データ:  
特願2003-329796 2003 年 9 月 22 日 (22.09.2003) JP
- (71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 日清キョーリン製薬株式会社 (NISSHIN KYORIN PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1010054 東京都千代田区神田錦町三丁目 1 番地 オームビル Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および  
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 清水 登 (SHIMIZU, Noboru) [JP/JP]; 〒3568511 埼玉県入間郡大井町鶴ヶ岡 5 丁目 3-1 日清キョーリン製薬株式会社 創薬研究所内 Saitama (JP).
- (74) 代理人: 稲葉 良幸, 外 (INABA, Yoshiyuki et al.); 〒1066123 東京都港区六本木 6-1 0-1 六本木ヒルズ森タワー 23 階 TMI 総合法律事務所 Tokyo (JP).
- (81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,

[続葉有]

(54) Title: 5-AMINOSALICYLIC ACID SOLID PREPARATION IMPROVED IN DISCOLORATION AND METHOD OF STORING THE SAME

(54) 発明の名称: 変色改善された 5-アミノサリチル酸固形製剤およびその保存方法

A 化合物名		N 混合末		O 錠剤	
		P 色差 (ΔE*)	変色防止率 Q (%)	P 色差 (ΔE*)	変色防止率 Q (%)
B チオリンゴ酸		1.53	93	6.91	58
C L-システイン		4.07	79	5.27	70
D N-アセチル-L-システイン		5.03	75	10.38	38
E 無水フタル酸		3.12	86	6.35	61
F 3,4-ピリジンジカルボン酸無水物		5.84	75	5.04	65
G 2,3-ナフタレンジカルボン酸無水物		6.27	74	4.81	67
H 3,3',4,4'-ベンゾフェノンテトラカルボン酸二無水物		6.30	73	7.02	51
I 塩化マグネシウム (無水)		3.48	84	4.36	76
J 亜硫酸水素ナトリウム	S 比較例1	11.95	43	—	—
K ピロ亜硫酸ナトリウム	S 比較例2	11.80	43	—	—
L アスコルビン酸	S 比較例3	23.52	0	—	—
M エデト酸ナトリウム	S 比較例4	22.30	0	—	—

A...DESCRIPTION OF COMPOUND  
B...THIOMALIC ACID  
C...L-CYSTEINE  
D...N-ACETYL-L-CYSTEINE  
E...PHTHALIC ANHYDRIDE  
F...3,4-PYRIDINEDICARBOXYLIC ACID ANHYDRIDE  
G...2,3-NAPHTHALENEDICARBOXYLIC ACID ANHYDRIDE  
H...3,3',4,4'-BENZOPHENONETETRACARBOXYLIC ACID DIANHYDRIDE  
I...MAGNESIUM CHLORIDE (ANHYDROUS)

J...SODIUM HYDROGEN SULFITE  
K...SODIUM PYROSULFITE  
L...ASCORBIC ACID  
M...SODIUM EDEATE  
N...MIXED POWDER  
O...TABLET  
P...DYE  
Q...PERCENTAGE OF DISCOLORATION PREVENTION  
R...EXAMPLE  
S...COMP. EX.

(57) Abstract: The change to brown color of 5-aminosalicylic acid solid preparations is inhibited, and the properties as drug product at production of 5-aminosalicylic acid solid preparations are preserved for a prolonged period of time. There are provided solid preparations obtained by formulating of 5-aminosalicylic acid or its salt and a discoloration preventive agent into medical preparations, which solid preparations exhibit in CIELAB color space a color difference of 10.5 or less brought about by storage at 80°C for one week. The above discoloration preventive agent is characterized by containing at least one member selected from the group consisting of a thiol compound, a sulfide compound, an acid anhydride and hygroscopic compounds.

(57) 要約: 本発明は、5-アミノサリチル酸固形製剤の褐変を抑制し、5-アミノサリチル酸固形製剤の製造時の製剤としての性状を、長期間保持させることを目的とする。本発明は、5-アミノサリチル酸又はその塩と、変色防止剤と、を製剤化してなる固形製剤であって、80°Cで1週間の保存前後において、CIELAB色空間におけ

[続葉有]



WO 2005/027932 A1



SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,  
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN,  
TD, TG).

(84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF,

添付公開書類:

— 国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

る前記固形製剤の色差が10.5以下である固形製剤を開示する。そして、前記変色防止剤は、チオール化合物、スルフィド化合物、酸無水物、および吸湿性化合物からなる群から選択される少なくとも1種を含むことを特徴とする。